Translation

PATENT COOPERATION TREATY





INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY (Chapter II of the Patent Cooperation Treaty)

(PCT Article 36 and Rule 70)

| Applicant's or accetic file of | | | | | |
|--|---|---|---|--|--|
| Applicant's or agent's file reference 54063 | FOR FURTHER ACT | ΓΙΟΝ | See Form PCT/IPEA/416 | | |
| International application No. | International filing date | (day/month/year) | Priority date (day/month/year) | | |
| PCT/EP2003/012774 | 14 November 200 | 3 (14.11.2003) | 15 November 2002 (15.11.2002) | | |
| International Patent Classification (IPC) or n C07D 487/04 | ational classification and | IPC | | | |
| Applicant B | ASF AKTIENGESE | LLSCHAFT et a | ıl. | | |
| This report is the international prelin Authority under Article 35 and trans | ninary examination report mitted to the applicant ac | , established by this cording to Article 30 | International Preliminary Examining 5. | | |
| 2. This REPORT consists of a total of | | cluding this cover s | heet. | | |
| 3. This report is also accompanied by A | NNEXES, comprising: | | | | |
| a. (sent to the applicant and | to the International Bured | nu) a total of | sheets, as follows: | | |
| sheets of the descr and/or sheets cont Administrative Ins | anning rectifications author | vings which have be orized by this Autho | een amended and are the basis of this report rity (see Rule 70.16 and Section 607 of the | | |
| sheets which supe beyond the disclos Supplemental Box | sheets which supersede earlier sheets, but which this Authority considers contain an amendment that goes beyond the disclosure in the international application as filed, as indicated in item 4 of Box No. I and the Supplemental Box. | | | | |
| | dicated in the Supplement | o a seguence listina | be and number of electronic carrier(s)) g and/or tables related thereto, in computer o Sequence Listing (see Section 802 of the | | |
| 4. This report contains indications relati | ing to the following items | : | | | |
| Box No. I Basis of the rep | port | , | | | |
| Box No. II Priority | | | | | |
| Box No. III Non-establishn | nent of opinion with regar | d to novelty, inventi | ive step and industrial applicability | | |
| Box No. IV Lack of unity o | | | | | |
| Box No. V Reasoned states citations and ex | ment under Article 35(2) cplanations supporting suc | with regard to novel | ty, inventive step or industrial applicability; | | |
| Box No. VI Certain docume | | | | | |
| Box No. VII Certain defects | in the international applic | cation | | | |
| | ations on the international | | | | |
| Date of submission of the demand | D | ate of completion of | f this report | | |
| 14 May 2004 (14.05.20 | 004) | 08 Fei | bruary 2005 (08.02.2005) | | |
| Name and mailing address of the IPEA/EP | A | uthorized officer | - | | |
| Facsimile No. | Te | elephone No. | | | |

INTERNATIONAL PRELIMIN

REPORT ON PATENTABILITY

| International | application No. |
|---------------|-----------------|
| F | EP2003/012774 |

| Box No. | I Ba | sis of the report |
|-----------|-------------------------------|--|
| 1. With a | regard to vise indi | the language, this report is based on the international application in the language in which it was filed, unless cated under this item. |
| | | port is based on translations from the original language into the following language, s language of a translation furnished for the purpose of: |
| | in | ternational search (under Rules 12.3 and 23.1(b)) |
| | D pı | ublication of the international application (under Rule 12.4) |
| | in | ternational preliminary examination (under Rules 55.2 and/or 55.3) |
| | | |
| furnis | hed to the re not an | to the elements of the international application, this report is based on (replacement sheets which have been the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" intexed to this report): |
| <u> </u> | | ernational application as originally filed/furnished |
| | the desc | · |
| | pages* | 1-41 , as originally filed/furnished received by this Authority on |
| | pages* | received by this Authority on |
| | | |
| | the clair | |
| | pages* | , as originally filed/furnished, as amended (together with any statement) under Article 19 |
| | pages* | received by this Authority on |
| | pages* | received by this Authority on |
| | the draw | vin an |
| | the draw | , as originally filed/furnished |
| | pages* | received by this Authority on |
| | pages* | received by this Authority on |
| | a ceque | nce listing and/or any related table(s) – see Supplemental Box Relating to Sequence Listing. |
| | u seque | not noting what of any related the local baseling to bequested bishing. |
| | Th | endments have resulted in the cancellation of: |
| 3 | | |
| | 듬 | ne description, pages |
| ļ | \equiv | ne claims, Nos. |
| • | = | ne drawings, sheets/figs |
| İ | = | ne sequence listing (specify): |
| | a | ny table(s) related to sequence listing (specify): |
| 4. | made, s (Rule 7) tt tt tt tt | port has been established as if (some of) the amendments annexed to this report and listed below had not been since they have been considered to go beyond the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box 0.2(c)). The description, pages |
| * If iten | n 4 appli | ies, some or all of those sheets may be marked "superseded." |

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.
PCT 03/12774

| V. | Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; |
|----|--|
| | citations and explanations supporting such statement |

| 1. | Statement | | | , <u>-</u> | | | |
|----|-------------------------------|--------|------|------------|----|-------|-----|
| | Novelty (N) | Claims | 1-14 | (all | in | part) | YES |
| | | Claims | | | | | NO |
| • | Inventive step (IS) | Claims | | | | | YES |
| | | Claims | 1-14 | (all | in | part) | NO |
| | Industrial applicability (IA) | Claims | 1-14 | (all | in | part) | YES |
| | | Claims | | | | | NO |

2. Citations and explanations

- 1. Since the applicant has not paid any further fees, this opinion applies only to the compounds in which X is bound to the ring by a carbon atom.
- 2. The following documents are available as the closest prior art:

D1: WO 02/088127 A (BAYER) 7 November 2002 (2002-11-07)

D2: WO 02/088126 A (BAYER) 7 November 2002 (2002-11-07)

- 3. Novelty over D1 and D2 is acknowledged, since the substituent X in the D1 and D2 compounds is always halogen.
- 4. D1 is the closest prior art. Said document describes compounds which can also be used against undesirable micro-organisms.

The problem addressed is considered that of providing further triazolopyrimidine derivatives that can control undesirable micro-organisms.

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No. PCT/03/12774

In view of the data given in the description, this problem is considered to be solved.

Although there is nothing in either D1 or D2 to induce a person skilled in the art to replace the halogen atom bound to the 5-position of the triazolopyrimidine ring by an optionally substituted alkyl chain and thereby to arrive at the compounds according to the invention, an inventive step cannot be acknowledged in respect of the whole scope claimed.

It is not clear from the teachings of D1 and/or D2 and from the content of the description why the claimed generalisation would be obvious to a person skilled in the art if the mere replacement of a halogen atom by a carbon atom is to be regarded as inventive.

An inventive step is therefore not acknowledged in respect of the whole scope.

5. Industrial applicability is established.



VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

PCT

REC'D 1 0 FEB 2005

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUN @SBERICHT

(Artikel 36 und Regel 70 PCT)

| Akte | | en de | s Anmelders oder Anwalts | WEITERES VOR | GEHEN slehe Mittellung vorläufigen Prü | g über die Übersendung des internationalen frungsberichts (Formblatt PCT/IPEA/416) | |
|--|---|---|--|---|---|--|--|
| | Internationales Aktenzeichen PCTÆP 03/12774 | | | Internationales Anmelo | dedatum (TagMonatUahr) | Prioritätsdatum (TagMonatUahr) 15.11.2002 | |
| C07 | 7D487 | | tentklassifikation (IPK) oder | nationale Klassifikation i | und IPK | | |
| | elder SF Ak | CTIEN | NGESELLSCHAFT et | al. | | | |
| 1. | Dies beau | er int uftrag | ernationale vorläufige Pr ten Behörde erstellt und | üfungsbericht wurde v wird dem Anmelder ge | ron der mit der internatio emäß Artikel 36 übermitt | nalen vorläufigen Prüfung telt. | |
| 2. | Dies | er BE | RICHT umfaßt insgesan | nt 4 Blätter einschließ | lich dieses Deckblatts. | | |
| und/oder Zeichnungen, gie (| | | örde vorgenommenen B | eandert wurden und d | liesem Bericht zuarunde | ätter mit Beschreibungen, Ansprüchen liegen, und/oder Blätter mit vor dieser itt 607 der Verwaltungsrichtlinien zum | |
| | Diese Anlagen umfassen insgesa | | | nt Blätter. | | | |
| 3. | Dies | er Be | richt enthält Angaben zu | folgenden Punkten: | | | |
| | I | \boxtimes | Grundlage des Besche | ids | | | |
| | 11 | | Priorität | | • | | |
| | Ш | | Keine Erstellung eines | Gutachtens über Neui | euheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit | | |
| | IV | \boxtimes | Mangelnde Einheitlichk | | | | |
| V 🛭 Begründete Feststellung nach Regel 66. gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlage | | ig nach Regel 66.2 a)i parkeit; Unterlagen und | i) hinsichtlich der Neuhe d Erklärungen zur Stützu | it, der erfinderischen Tätigkeit und der Ing dieser Feststellung | | | |
| | VI | | Bestimmte angeführte | | | • | |
| | VII | | Bestimmte Mängel der | internationalen Anmel | | | |
| | VIII | | Bestimmte Bemerkung | en zur internationalen | Anmeldung | | |
| Datu | m der l | Einreid | chung des Antrags | | Datum der Fertigstellung | dieses Berichts | |
| 14.0 | 05.200 | 04 | | | 08.02.2005 | | |
| Name | e und i | Postan | schrift der mit der internatio | nalen Prüfung | Bevollmächtigter Bediens | steter | |
| | <u>)</u> | Eur D-8 Tel | opäisches Patentamt 10298 München 1 +49 89 2399 - 0 Tx: 52365 1: +49 89 2399 - 4465 | 6 epmu d | Ousset, J-B | of the state of th | |
| | | | | | Tel. +49 89 2399-8271 | Oute outside | |

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 03/12774

| C | dlage | 4 | Dav | ahta |
|------|-------|-----|-----|-------|
| Grun | aiace | aes | Ber | icnts |

1. Hinsichtlich der Bestandteile der internationalen Anmeldung (Ersatzblätter, die dem Anmeldeamt auf eine Aufforderung nach Artikel 14 hin vorgelegt wurden, gelten im Rahmen dieses Berichts als "ursprünglich eingereicht" und sind ihm nicht beigefügt, weil sie keine Änderungen enthalten (Regeln 70.16 und 70.17)):

| | Bes | chreibung, Seiten | |
|----|--------------|--|---|
| | 1-41 | | in der ursprünglich eingereichten Fassung |
| | Ans | prüche, Nr. | |
| | 1-14 | Į. | in der ursprünglich eingereichten Fassung |
| 2. | die i | nternationale Anmelo | : Alle vorstehend genannten Bestandteile standen der Behörde in der Sprache, in der dung eingereicht worden ist, zur Verfügung oder wurden in dieser eingereicht, sofern s anderes angegeben ist. |
| | Die eing | Bestandteile standen ereicht; dabei handel | der Behörde in der Sprache: zur Verfügung bzw. wurden in dieser Sprache lt es sich um: |
| | | die Sprache der Übe (nach Regel 23.1(b)) | ersetzung, die für die Zwecke der internationalen Recherche eingereicht worden ist |
| | | die Veröffentlichungs | ssprache der internationalen Anmeldung (nach Regel 48.3(b)). |
| | | die Sprache der Übe worden ist (nach Re | ersetzung, die für die Zwecke der internationalen vorläufigen Prüfung eingereicht gel 55.2 und/oder 55.3). |
| 3. | Hins inte | sichtlich der in der inte rnationale vorläufige l | ernationalen Anmeldung offenbarten Nucleotid- und/oder Aminosäuresequenz ist d Prüfung auf der Grundlage des Sequenzprotokolls durchgeführt worden, das: |
| | | in der internationaler | n Anmeldung in schriftlicher Form enthalten ist. |
| | | zusammen mit der ir | nternationalen Anmeldung in computerlesbarer Form eingereicht worden ist. |
| | | bei der Behörde nac | hträglich in schriftlicher Form eingereicht worden ist. |
| | | bei der Behörde nac | hträglich in computerlesbarer Form eingereicht worden ist. |
| | | | das nachträglich eingereichte schriftliche Sequenzprotokoll nicht über den der internationalen Anmeldung im Anmeldezeitpunkt hinausgeht, wurde vorgelegt. |
| | | Die Erklärung, daß d Sequenzprotokoll en | die in computerlesbarer Form erfassten Informationen dem schriftlichen itsprechen, wurde vorgelegt. |
| 4. | Auf | grund der Änderunge | n sind folgende Unterlagen fortgefallen: |
| | | Beschreibung, | Seiten: |
| | | Ansprüche, | Nr.: |
| | | Zeichnungen, | Blatt: |
| 5. | | angegebenen Gründ | ne Berücksichtigung (von einigen) der Änderungen erstellt worden, da diese aus den den nach Auffassung der Behörde über den Offenbarungsgehalt in der ursprünglich ing hinausgehen (Regel 70.2(c)). |
| | • | (Auf Ersatzblätter, d beizufügen.) | lie solche Änderungen enthalten, ist unter Punkt 1 hinzuweisen; sie sind diesem Berich |

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT

Internationales Aktenzeichen PCT/EP 03/12774

6. Etwaige zusätzliche Bemerkungen:

| IV. Mangelnde Einheitlichkeit der Erfind: |
|---|
|---|

| IV. | war | igeinde Einneitlichkeit der Er | ımaun | ıg | • | |
|-----|--------------------------------|---|---------------------|------------------------------|---|----|
| 1. | | die Aufforderung zur Einschrän nelder: | kung c | ier Ansprüch | he oder zur Zahlung zusätzlicher Gebühren hat der | |
| | ☐ die Ansprüche eingeschränkt. | | | | | |
| | | zusätzliche Gebühren entrichte | et. | | | |
| | | zusätzliche Gebühren unter W | iderspi | ruch entrichte | tet. | |
| | ☒ | weder die Ansprüche eingesch | nränkt i | noch zusätzli | liche Gebühren entrichtet. | |
| 2. | | | n, den | Anmelder ni | der Einheitlichkeit der Erfindung nicht erfüllt ist, und hat nicht zur Einschränkung der Ansprüche oder zur Zahlung | |
| 3. | | Behörde ist der Auffassung, da 2 und 13.3 | ıß das | Erfordernis d | der Einheitlichkeit der Erfindung nach den Regeln 13.1, | |
| | | erfüllt ist. | | | | |
| | | aus folgenden Gründen nicht e | erfüllt is | st: | | |
| 4. | Dah inte | ner wurde zur Erstellung dieses rnationalen Anmeldung durchg | Berich eführt: | nts eine interr | mationale vorläufige Prüfung für folgende Teile der | |
| | \Box alle Teile. | | | | | |
| | | die Teile, die sich auf die Ansp | rüche | Nr. 1-14 (alle | le teilweise) beziehen. | |
| ٧. | Beg gev | gründete Feststellung nach A verblichen Anwendbarkeit; U | rtikel (nterlaç | 35(2) hinsich gen und Erk | chtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und o klärungen zur Stützung dieser Feststellung | de |
| 1. | | ststellung uheit (N) | Ja: Nein: | Ansprüche Ansprüche | 1-14(alle teilweise) | |
| | Erfi | nderische Tätigkeit (IS) | Ja: | Ansprüche | | |
| i | ; Ge | werbliche Anwendbarkeit (IA) | Ja: | | 1-14(alle teilweise) : 1-14(alle teilweise) : | |
| 2. | Uni | terlagen und Erklärungen: | | | | |
| | sie | he Beiblatt | | | | |

SECTION V

- Da die Anmelderin keine weiteren Gebühren bezahlt hat, gilt dieses Gutachten 1). lediglich für die Verbindungen, in denen X durch ein Kohlenstoffatom am Ring gebunden ist.
- Folgende Dokumente stehen als nächstliegender Stand der Technik zur Verfügung:

D1: WO 02/088127 A (BAYER) 7. November 2002 (2002-11-07) D2: WO 02/088126 A (BAYER) 7. November 2002 (2002-11-07)

- Neuheit gegenüber D1 und D2 wird anerkannt, da der Substituent X in den Verbindungen von D1 und D2 immer Halogen darstellt.
- D1 stellt den nächstliegenden Stand der Technik dar. Dieses Dokument beschreibt Verbindungen, die auch gegen unerwünschte Mikroorganismen einsetzbar sind.

Die zu lösende Aufgabe wird darin gesehen, weitere Triazolopyrimidinderivate bereitzustellen, die unerwünschte Mikroorganismen bekämpfen können.

Angesichts der in der Beschreibung angegebenen Daten wird die Aufgabe als gelöst angesehen.

Obwohl der Fachmann weder in D1 noch in D2 irgendeine Veranlassung finden kann, um das an der Stelle 5 des Triazolopyrimidinrings gebundene Halogenatom durch eine gegebenenfalls substituierte Alkylkette zu ersetzen und dadurch zu den erfindungsgemäßen Verbindungen zu gelangen, kann eine erfinderische Tätigkeit für den ganzen beanspruchten Umfang nicht anerkannt werden. Aus den Lehren von D1 und/oder D2 und aus dem Inhalt der Beschreibung ist es nicht

ersichtlich, aus welchem Grund die beanspruchte Verallgemeinerung für den Fachmann naheliegend wäre, wenn der bloße Ersatz eines Halogenatoms durch ein Kohlenstoffatom als erfinderisch zu betrachten ist.

Eine erfindeische Tätigkeit ist daher für den gesamten Umfang nicht anerkannt.

Es gibt keinen Einwand hinsichtlich der gewerblichen Anwendbarkeit. 5).